

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和1年10月17日(2019.10.17)

【公表番号】特表2018-529674(P2018-529674A)

【公表日】平成30年10月11日(2018.10.11)

【年通号数】公開・登録公報2018-039

【出願番号】特願2018-511682(P2018-511682)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/08	(2006.01)
A 6 1 K	33/26	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/14
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/02
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/12
A 6 1 P	7/06
A 6 1 P	7/08
A 6 1 K	33/26

【手続補正書】

【提出日】令和1年9月2日(2019.9.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

製粉された可溶性ピロリン酸(pyrrosphosphate)第二鉄を含む、可溶性ピロリン酸第二鉄の固体微粒子製剤であって、前記粒子の90%は、1μm～50μmの間の粒径を有し、前記可溶性ピロリン酸第二鉄が1分未満で水溶液に溶解する、固体微粒子製剤。

【請求項2】

前記粒子の90%が、5μm～50μmの間の粒径を有する、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項3】

前記粒子の90%が、3μm～40μmの間の粒径を有する、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項4】

前記粒子の90%が、10μm～30μmの間の粒径を有する、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項5】

前記粒子の90%が、1μm～25μmの間の粒径を有する、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項6】

粒径中央値が、約15μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項7】

粒径中央値が、約14μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項8】

粒径中央値が、約13μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項9】

粒径中央値が、約12μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項10】

粒径中央値が、約11μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項11】

粒径中央値が、約10μm未満である、請求項1に記載の固体微粒子製剤。

【請求項12】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、45度未満の安息角を有する、請求項1～11のいずれかに記載の固体微粒子製剤。

【請求項13】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、42度未満の安息角を有する、請求項1～11のいずれかに記載の固体微粒子製剤。

【請求項14】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、41度～45度の間の安息角を有する、請求項1～11のいずれかに記載の固体微粒子製剤。

【請求項15】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、約41度の安息角を有する、請求項1～11のいずれかに記載の固体微粒子製剤。

【請求項16】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、7重量%～11重量%の量の鉄、少なくとも14%の量のシトレーント、および少なくとも10%の量のピロホスフェートを含む、請求項1～15のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

【請求項17】

7.5～9.0重量%の量の鉄、15～22重量%の量のシトレーント、15～22重量%の量のピロホスフェート、2%未満の量のホスフェート、18～25重量%の量のナトリウム、および20～35重量%の量のサルフェートを含む、請求項1～16のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

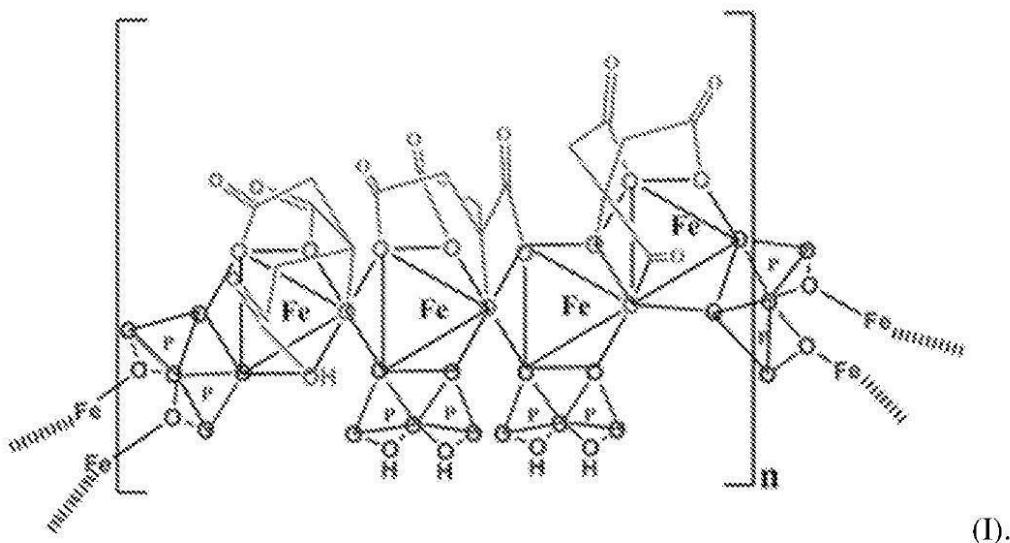
【請求項18】

9～14重量%の量の鉄、30～60重量%の量のシトレーント、5～20重量%の量のピロホスフェート、1～15重量%の量のナトリウムを含み、サルフェートを本質的に含まない、請求項1～17のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

【請求項19】

構造(I)

【化4】



を有する化合物を含む、請求項1～18のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

【請求項20】

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、第1の配位殻において2.00 オングストロームの Fe - O 距離、2.98 オングストロームの Fe - C 距離、および Fe の第2の配位圏において3.20 オングストロームの Fe - P 距離の少なくとも1つを有する、シトレートおよびピロホスフェートとキレートを形成した鉄を含む、請求項1～19のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0079

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0079】

前述の本発明を、明確な理解を目的として例示および実施例としていくらか詳細に記載してきたが、添付の特許請求の範囲の精神または範囲から逸脱することなく、ある特定の変更および改変を加え得ることが、本開示の教示に照らして当業者には容易に明らかとなろう。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

5 μM未満、任意選択で4 μM未満の粒径を有する可溶性ピロリン酸(pyratosphosphate)第二鉄を含む、可溶性ピロリン酸第二鉄の固体微粒子製剤であって、前記可溶性ピロリン酸第二鉄が1分未満で水溶液に溶解する、固体微粒子製剤。

(項目2)

水溶液中の前記可溶性ピロリン酸第二鉄の溶解度が、1mL当たり1グラムを超える、項目2に記載の固体微粒子製剤。

(項目3)

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、45度未満、任意選択で42度未満の安息角を有する、項目1または2に記載の固体微粒子製剤。

(項目4)

水溶液中で周囲温度において少なくとも24ヶ月間安定な、項目1～3のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

(項目5)

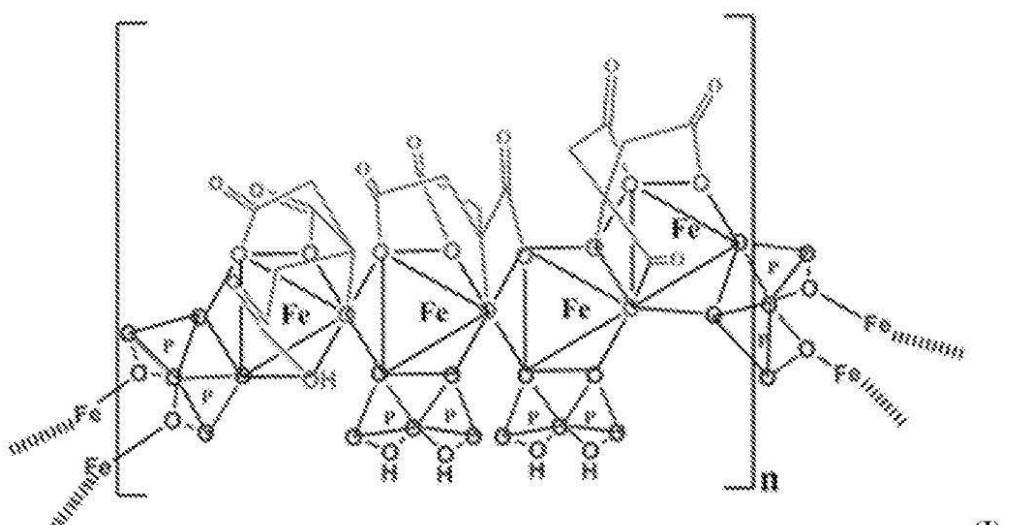
前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、7重量%～11重量%の量の鉄、少なくとも14%の量のシトレーント、および少なくとも10%の量のピロホスフェートを含む、項目1～4のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

(項目6)

7.5～9.0重量%の量の鉄、15～22重量%の量のシトレーント、15～22重量%の量のピロホスフェート、2%未満の量のホスフェート、18～25重量%の量のナトリウム、および20～35重量%の量のサルフェートを含む、項目1～5のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

(項目7)

9～14重量%の量の鉄、30～60重量%の量のシトレーント、5～20重量%の量のピロホスフェート、1～15重量%の量のナトリウムを含み、サルフェートを本質的に含まない、項目1～4のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

(項目8)構造(I)【化4】

(I).

を有する化合物を含む、項目1～4のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤。

(項目9)

項目1～8のいずれか一項に記載の固体微粒子製剤を含む、サシェ剤。

(項目10)

血液透析を受ける患者に投与される透析液における最終的な鉄濃度を110μg/Lまたは2μMにする用量の可溶性ピロリン酸第二鉄を含む、項目9に記載のサシェ剤。

(項目11)

a)透析液を形成するために、可溶性ピロリン酸第二鉄の固体微粒子製剤を血液透析溶液と混合するステップと、

b)前記透析液を、それを必要とする対象に投与するステップと
を含む、可溶性ピロリン酸第二鉄を投与する改善された方法。

(項目12)

前記透析溶液が、酸溶液である、項目11に記載の方法。

(項目13)

前記酸溶液が、水、塩化ナトリウム、塩化カリウム、塩化カルシウム、塩化マグネシウム、ブドウ糖、およびクエン酸もしくは酢酸、またはクエン酸塩もしくは酢酸塩を含む、項目12に記載の方法。

(項目14)

前記酸溶液中の前記固体微粒子製剤の溶解度が、1mL当たり1グラムを超える、項目12または13に記載の方法。

(項目15)

前記透析溶液が、塩基溶液である、項目11に記載の方法。

(項目16)

前記塩基溶液が、炭酸水素ナトリウム、または炭酸水素ナトリウムおよび塩化ナトリウムの組合せを含む、項目15に記載の方法。

(項目17)

前記塩基溶液中の前記固体微粒子製剤の溶解度が、1mL当たり1グラムを超える、項目15または16に記載の方法。

(項目18)

前記可溶性ピロリン酸第二鉄を混合するステップによって、前記透析液における最終的な鉄濃度が、約100μg/L～約150μg/Lになる、項目11～17のいずれか一項に記載の方法。

(項目19)

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、シトレーントおよびピロホスフェートとキレートを形成した鉄を含む、項目11～18のいずれか一項に記載の方法。

(項目20)

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、7重量%～11重量%の量の鉄、少なくとも14%の量のシトレーント、および少なくとも10%の量のピロホスフェートを含む、項目11～19のいずれか一項に記載の方法。

(項目21)

前記固体微粒子製剤が、7.5～9.0重量%の量の鉄、15～22重量%の量のシトレーント、15～22重量%の量のピロホスフェート、2%未満の量のホスフェート、18～25重量%の量のナトリウム、および20～35重量%の量のサルフェートを含む、項目11～20のいずれか一項に記載の方法。

(項目22)

前記固体微粒子製剤が、9～14重量%の量の鉄、30～60重量%の量のシトレーント、5～20重量%の量のピロホスフェート、1～15重量%の量のナトリウムを含み、サルフェートを本質的に含まない、項目11～19のいずれか一項に記載の方法。

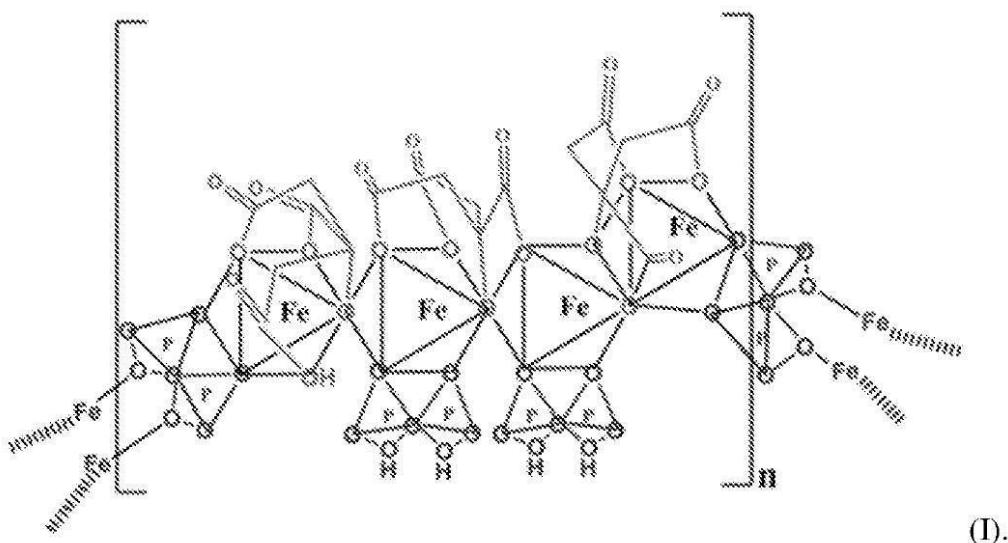
(項目30)

前記可溶性ピロリン酸第二鉄が、第1の配位殻において2.00オングストロームのFe-O距離、2.98オングストロームのFe-C距離、およびFeの第2の配位殻において3.20オングストロームのFe-P距離の少なくとも1つを有する、シトレーントおよびピロホスフェートとキレートを形成した鉄を含む、項目11～19のいずれか一項に記載の方法。

(項目31)

前記固体微粒子製剤が、構造(I)

【化5】



を有する化合物を含む、項目11～19のいずれか一項に記載の方法。

(項目23)

項目1～10のいずれか一項に記載の可溶性ピロリン酸第二鉄の固体微粒子製剤またはサシェ剤、および固体形態または液体形態の透析濃縮製剤を含む、キット。

(項目24)

前記透析濃縮製剤が、固体形態である、項目23に記載のキット。

(項目25)

前記透析濃縮製剤が、液体形態である、項目23に記載のキット。

(項目26)

前記透析濃縮製剤が、酸である、項目23～25のいずれかに記載のキット。

(項目27)

前記透析濃縮製剤が、塩基である、項目23～25のいずれかに記載のキット。